

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 mars 2005 (17.03.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2005/023817 A1

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 493/04, A61K 31/36, A61P 35/00

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/002218

(22) Date de dépôt international :  
1 septembre 2004 (01.09.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0310367 2 septembre 2003 (02.09.2003) FR

(71) Déposants (pour tous les États désignés sauf US) : LES  
LABORATOIRES SERVIER [FR/FR]; 12, Place de  
la Défense, F-92415 Courbevoie Cedex (FR). CNRS  
[FR/FR]; 3 rue Michel Ange, F-75794 Paris Cedex 16  
(FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : MON-  
NERET, Claude [FR/FR]; 9, avenue Lamoricière,  
F-75012 Paris (FR). DAUZONNE, Daniel [FR/FR];  
17, rue Pelée, F-75011 Paris (FR). HICKMAN, John  
[GB/FR]; 136, rue de Tocqueville, F-75017 Paris (FR).

PIERRE, Alain [FR/FR]; 9, chemin des Bois Jancaudes,  
F-78580 les Alluets le Roi (FR). KRAUS-BERTHIER,  
Laurence [FR/FR]; 20, petite rue des Champarons,  
F-92700 Colombes (FR). PFEIFFER, Bruno [FR/FR];  
47, rue Ernest Renan, F-95320 Saint Leu la Foret (FR).  
RENARD, Pierre [FR/FR]; 3, avenue du Parc, F-78150  
Le Chesnay (FR).

(74) Représentant commun : LES LABORATOIRES  
SERVIER; 12, Place de la Défense, F-92415 Courbevoie  
Cedex (FR).

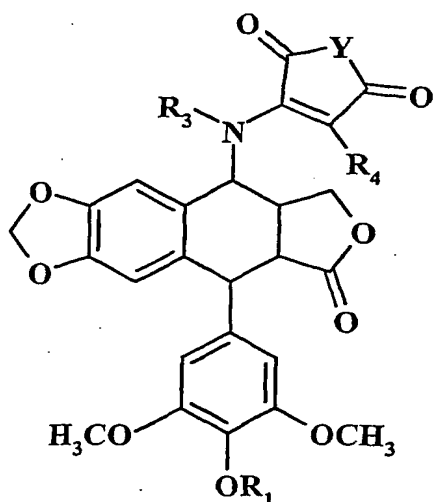
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,  
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre  
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: 9-AMINO-PODOPHYLLOTOXIN DERIVATIVES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND PHAR-  
MACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAID DERIVATIVES

(54) Titre : DERIVES DE 9-AMINO-PODOPHYLLOTOXINE, LEUR PROCEDE DE PREPARATION ET LES COMPOSI-  
TIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT



(I)

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula (I), wherein R<sub>1</sub> is a group selected from hydrogen, alkyl, aryl, arylalkyl, heteroaryl, heteroarylalkyl, alkylcarbonyl, arylcarbonyl, arylalkylcarbonyl, alkoxycarbonyl, aryloxy carbonyl, arylalkoxy carbonyl, heterocycloalkoxycarbonyl, alkylsulfonyl, arylsulfonyl, arylalkylsulfonyl, phosphonic and Si(Ra)<sub>2</sub>R<sub>b</sub>, Y is a group selected from HN-NH and N-R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> is a hydrogen atom, an alkyl, cycloalkyl, aryl, arylalkyl group, R<sub>4</sub> is hydrogen atom or an alkyl group, enantiomers, diastereoisomers and the salts thereof.

(57) Abrégé : Composés de formule (I) dans laquelle R<sub>1</sub> représente un groupement choisi parmi hydrogène, alkyle, aryle, arylalkyle, hétéroaryle, hétéroarylalkyle, alkylcarbonyle, arylcarbonyle, arylalkylcarbonyle, alkoxycarbonyle, aryloxy carbonyle, arylalkoxy carbonyle, hétérocycloalkoxycarbonyle, alkylsulfonyle, arylsulfonyle, arylalkylsulfonyle, phosphonique et Si(Ra)<sub>2</sub>R<sub>b</sub>, Y représente un groupement choisi parmi HN-NH et N-R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> représente un atome d'hydrogène, un groupement alkyle, cycloalkyle, aryle, arylalkyle, R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène ou un groupement alkyle, leurs énantiomères, diastéréoisomères ainsi que leurs sels d'addition à un acide ou à une base

pharmaceutiquement acceptable. Médicaments.

WO 2005/023817 A1



FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,  
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

*En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrévia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.*

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale